

特許協力条約

発信人 日本国特許庁（国際調査機関）

REC'D 03 MAR 2005

WIPO

PCT

出願人代理人

高島 一

様

あて名

〒 541-0044

大阪府大阪市中央区伏見町4-1-1  
明治安田生命大阪御堂筋ビル

PCT

国際調査機関の見解書  
(法施行規則第40条の2)  
[PCT規則43の2.1]

発送日  
(日.月.年)

01.3.2005

出願人又は代理人  
の書類記号

09716

今後の手続きについては、下記2を参照すること。

国際出願番号

PCT/J P 2005/000627

国際出願日

(日.月.年) 13.01.2005

優先日

(日.月.年) 14.01.2004

国際特許分類 (IPC) Int. Cl<sup>7</sup> C07D211/62, 211/78, 223/06, 401/06, A61K31/4418, 31/451, 31/55, 31/454, A61P35/00, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00, 15/00, 17/00, 19/02, 19/08, 25/00, 25/02, 27/02, 29/00, 29/02, 31/00, 1/00, 1/16 (補充欄に続く)

出願人 (氏名又は名称)

武田薬品工業株式会社

1. この見解書は次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 見解の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT規則43の2.1(a)(i)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☒ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

2. 今後の手続き

国際予備審査の請求がされた場合は、出願人がこの国際調査機関とは異なる国際予備審査機関を選択し、かつ、その国際予備審査機関がPCT規則66.1の2(b)の規定に基づいて国際調査機関の見解書を国際予備審査機関の見解書とみなさない旨を国際事務局に通知していた場合を除いて、この見解書は国際予備審査機関の最初の見解書とみなされる。

この見解書が上記のように国際予備審査機関の見解書とみなされる場合、様式PCT/ISA/220を送付した日から3月又は優先日から22月のうちいずれか遅く満了する期限が経過するまでに、出願人は国際予備審査機関に、適当な場合は補正書とともに、答弁書を提出することができる。

さらなる選択肢は、様式PCT/ISA/220を参照すること。

3. さらなる詳細は、様式PCT/ISA/220の備考を参照すること。

見解書を作成した日

15.02.2005

名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)  
郵便番号 100-8915  
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)  
安藤 倫世

4 P

9837

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

様式PCT/ISA/237 (表紙) (2004年1月)

## 第I欄 見解の基礎

1. この見解書は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎として作成された。

- ☐ この見解書は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎として作成した。  
それは国際調査のために提出されたPCT規則12.3及び23.1(b)にいう翻訳文の言語である。

2. この国際出願で開示されかつ請求の範囲に係る発明に不可欠なヌクレオチド又はアミノ酸配列に関して、以下に基づき見解書を作成した。

- a. タイプ ☐ 配列表  
☐ 配列表に関連するテーブル
- b. フォーマット ☐ 書面  
☐ コンピュータ読み取り可能な形式
- c. 提出時期 ☐ 出願時の国際出願に含まれる  
☐ この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出された  
☐ 出願後に、調査のために、この国際調査機関に提出された

3. ☐ さらに、配列表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列若しくは追加して提出した配列が出願時に提出した配列と同一である旨、又は、出願時の開示を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

4. 補足意見：

## 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 10

理由：

☒ この国際出願又は請求の範囲 10 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求項10は、治療による人体の処置方法に関するものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 10 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ スクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

- ☐ 提出されていない。
- ☐ 所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

- ☐ 提出されていない。
- ☐ 所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるスクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

- ☐ 提出されていない。
- ☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についてのPCT規則43の2.1(a)(i)に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 2-4, 8, 9, 11	有 無
	請求の範囲 1, 5-7	
進歩性 (IS)	請求の範囲	有 無
	請求の範囲 1-9, 11	
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲 1-9, 11	有 無
	請求の範囲	

## 2. 文献及び説明

文献1: WO 2004/002957 A1 (ACTELION PHARMACEUTICALS, LTD.) 2004.01.08  
文献2: WO 03/101964 A1 (武田薬品工業株式会社) 2003.12.11  
文献3: JP 8-67678 A (武田薬品工業株式会社) 1996.03.12  
文献4: JP 7-10844 A (武田薬品工業株式会社) 1995.01.13  
文献5: WO 02/081457 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 2002.10.17  
文献6: WO 01/025219 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 2001.04.12

[1] 請求の範囲1及び5-7に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献1により新規性及び進歩性を有しない。

文献1には、請求の範囲1に記載の一般式(I)に相当する化合物が記載されている。

文献1には更に、当該化合物を肺高血圧症、循環器疾患、腎疾患、移植後の免疫抑制、緑内障等の治療に用いることが記載されている。

文献1には、タキキニン受容体拮抗作用についての開示はないが、本願発明のタキキニン受容体拮抗剤もまた、肺高血圧症、循環器疾患、腎疾患、移植後の免疫抑制、緑内障等の治療に用いるものであり、これを、文献1における適用範囲と、医薬用途として区別することができない。

したがって、請求の範囲1及び5-7に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献1に記載された発明と同一である。

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書(PCT規則43の2.1及び70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 2004/105738 A2 (ACTELION PHARMACEUTICALS, LTD.) 「EX」	09.12.2004	12.05.2004	30.05.2003

2. 書面による開示以外の開示(PCT規則43の2.1及び70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

## 第Ⅳ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1-3 の「置換基を有していてもよい」及び、請求の範囲 5、6、11 の「プロドラッグ」なる記載は、いかなる構造の化合物までを包含するものであるかを不明確にする記載であり、明細書の記載を参酌しても、明確に定義されているものとも認められない。

したがって、請求の範囲 1-3、5、6、11 及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 欄の続き

国際特許分類 (IPC) の続き

Int. Cl<sup>7</sup> A61P1/18, 3/00, 5/00, 7/00, 9/00, 11/00, 11/02, 13/02

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

[2] 請求の範囲 2-4 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1 と国際調査報告で引用された上記文献 2-6 とにより進歩性を有しない。

上記 [1] 参照。

請求の範囲 2-4 に係る化合物は、文献 1 記載の化合物とは、請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) における含窒素複素環 (A 環に相当) 芳香環 (B 環及び C 環に相当) に結合する置換基において相違している。

しかしながら、文献 1 記載の化合物に構造の非常に類似した、医薬として有用な化合物が種々記載された文献 2-6 には、含窒素複素環の窒素に結合する置換基としてアシル基、芳香環上の置換基としてハロゲン化アルキル基等が好ましいものとして記載されている。

そうしてみると、文献 1 に記載の医薬として有用な化合物において、文献 2-6 記載の置換基を採用してみることは、当業者であれば、容易に想到し得るものと認められる。

そして、請求の範囲 2-4 に係る化合物が、上記文献に記載された公知化合物に比較して、予想外の効果を奏するものとも認められない。

[3] 請求の範囲 8、9、11 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1 と国際調査報告で引用された上記文献 2-6 とにより進歩性を有しない。

上記 [1] 及び [2] 参照。

文献 2-6 に記載されるように、含窒素複素環と二つの芳香環を必須とする化合物からなるタキキニン受容体拮抗剤として有用な化合物は種々知られており、請求の範囲 1-4 に係る化合物は、文献 2 記載の化合物とは、請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) における含窒素複素環 (A 環に相当) と、芳香環 (B 環に相当) に結合するメチレンとの結合が、アミド結合である点のみ相違している。

しかしながら、文献 3-6 には、含窒素複素環と、芳香環に結合するメチレンとの結合が、アミド結合であるタキキニン受容体拮抗剤として有用な化合物が種々記載されている。

そうしてみると、文献 2 に記載のタキキニン受容体拮抗剤として有用な化合物において、含窒素複素環と、芳香環に結合するメチレンとの結合部位にアミド結合を採用してみることは、当業者であれば、容易に想到し得るものと認められる。

そして、請求の範囲 8、9、11 に係るタキキニン受容体拮抗剤が、上記文献に記載されたタキキニン受容体拮抗剤に比較して、予想外の効果を奏するものとも認められない。



特許協力条約

発信人 日本国特許庁（国際調査機関）

REC'D 03 MAR 2005

WIPO

PCT

出願人代理人

高島 一

様

あて名

〒 541-0044

大阪府大阪市中央区伏見町4-1-1

明治安田生命大阪御堂筋ビル

PCT

国際調査機関の見解書

（法施行規則第40条の2）

〔PCT規則43の2.1〕

発送日  
（日.月.年）

01.3.2005

出願人又は代理人  
の書類記号

09716

今後の手続きについては、下記2を参照すること。

国際出願番号

PCT/JP2005/000627

国際出願日

（日.月.年） 13.01.2005

優先日

（日.月.年） 14.01.2004

国際特許分類（IPC） Int. Cl<sup>7</sup> C07D211/62, 211/78, 223/06, 401/06, A61K31/4418, 31/451, 31/55, 31/454, A61P35/00, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00, 15/00, 17/00, 19/02, 19/08, 25/00, 25/02, 27/02, 29/00, 29/02, 31/00, 1/00, 1/16（補充欄に続く）

出願人（氏名又は名称）

武田薬品工業株式会社

1. この見解書は次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 見解の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT規則43の2.1(a)(i)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☒ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

2. 今後の手続き

国際予備審査の請求がされた場合は、出願人がこの国際調査機関とは異なる国際予備審査機関を選択し、かつ、その国際予備審査機関がPCT規則66.1の2(b)の規定に基づいて国際調査機関の見解書を国際予備審査機関の見解書とみなさない旨を国際事務局に通知していた場合を除いて、この見解書は国際予備審査機関の最初の見解書とみなされる。

この見解書が上記のように国際予備審査機関の見解書とみなされる場合、様式PCT/ISA/220を送付した日から3月又は優先日から22月のうちいずれか遅く満了する期限が経過するまでに、出願人は国際予備審査機関に、適当な場合は補正書とともに、答弁書を提出することができる。

さらなる選択肢は、様式PCT/ISA/220を参照すること。

3. さらなる詳細は、様式PCT/ISA/220の備考を参照すること。

見解書を作成した日

15.02.2005

名称及びあて先

日本国特許庁（ISA/JP）

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官（権限のある職員）

安藤 倫世

4P

9837

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

様式PCT/ISA/237（表紙）（2004年1月）

## 第I欄 見解の基礎

1. この見解書は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎として作成された。

- ☐ この見解書は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎として作成した。  
それは国際調査のために提出されたPCT規則12.3及び23.1(b)にいう翻訳文の言語である。

2. この国際出願で開示されかつ請求の範囲に係る発明に不可欠なヌクレオチド又はアミノ酸配列に関して、  
以下に基づき見解書を作成した。

- a. タイプ ☐ 配列表  
☐ 配列表に関連するテーブル
- b. フォーマット ☐ 書面  
☐ コンピュータ読み取り可能な形式
- c. 提出時期 ☐ 出願時の国際出願に含まれる  
☐ この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出された  
☐ 出願後に、調査のために、この国際調査機関に提出された

3. ☐ さらに、配列表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列若しくは追加して提出した配列が出願時に提出した配列と同一である旨、又は、出願時の開示を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

4. 補足意見：

## 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 10

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 10 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求項10は、治療による人体の処置方法に関するものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 10 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ スクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

☐ 提出されていない。  
☐ 所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

☐ 提出されていない。  
☐ 所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるスクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

☐ 提出されていない。  
☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

## 第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についてのPCT規則43の2.1(a)(i)に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	2-4, 8, 9, 11	有 無
	請求の範囲	1, 5-7	
進歩性 (IS)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1-9, 11	
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-9, 11	有 無
	請求の範囲		

## 2. 文献及び説明

- 文献1: WO 2004/002957 A1 (ACTELION PHARMACEUTICALS, LTD.) 2004.01.08  
 文献2: WO 03/101964 A1 (武田薬品工業株式会社) 2003.12.11  
 文献3: JP 8-67678 A (武田薬品工業株式会社) 1996.03.12  
 文献4: JP 7-10844 A (武田薬品工業株式会社) 1995.01.13  
 文献5: WO 02/081457 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 2002.10.17  
 文献6: WO 01/025219 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 2001.04.12

[1] 請求の範囲1及び5-7に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献1により新規性及び進歩性を有しない。

文献1には、請求の範囲1に記載の一般式(I)に相当する化合物が記載されている。

文献1には更に、当該化合物を肺高血圧症、循環器疾患、腎疾患、移植後の免疫抑制、緑内障等の治療に用いることが記載されている。

文献1には、タキキニン受容体拮抗作用についての開示はないが、本願発明のタキキニン受容体拮抗剤もまた、肺高血圧症、循環器疾患、腎疾患、移植後の免疫抑制、緑内障等の治療に用いるものであり、これを、文献1における適用範囲と、医薬用途として区別することができない。

したがって、請求の範囲1及び5-7に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献1に記載された発明と同一である。

## 第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1-3 の「置換基を有していてもよい」及び、請求の範囲 5、6、11 の「プロドラッグ」なる記載は、いかなる構造の化合物までを包含するものであるかを不明確にする記載であり、明細書の記載を参酌しても、明確に定義されているものとも認められない。

したがって、請求の範囲 1-3、5、6、11 及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書(PCT規則43の2.1及び70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 2004/105738 A2 (ACTELION PHARMACEUTICALS, LTD.) 「EX」	09. 12. 2004	12. 05. 2004	30. 05. 2003

2. 書面による開示以外の開示(PCT規則43の2.1及び70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

91年刊「第4版 実験化学講座22、有機合成IV」などに記載されている方法、あるいはそれに準じる方法により行うことができる。それらの方法としては、例えば、縮合剤を用いる方法、反応性誘導体を経る方法などが挙げられる。

「縮合剤を用いる方法」において使用される縮合剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、N-エチル-N'-3-ジメチルアミノプロピルカルボジイミドおよびその塩酸塩、ベンゾトリアゾール-1-イル-トリシメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロリン化物塩、ジフェニルホスホリルアジドなどが挙げられる。これらは単独で、もしくは添加剤(例、N-ヒドロキシスクシンイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールあるいは3-ヒドロキシ-4-オキソ-3,4-ジヒドロ-1,2,3-ベンゾトリアジンなど)と組み合わせて用いることもできる。縮合剤の使用量は化合物(IVa)1モルに対して、約1~10モル当量であり、好ましくは約1~2モル当量程度である。添加剤の使用量は化合物(IVa)1モルに対して、約1~10モル当量であり、好ましくは約1~2モル当量程度である。上記反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない溶媒中で行われ、反応促進のため便宜の塩基を添加しても良い。溶媒としては、例えば、炭化水素類(ベンゼン、トルエンなど)、エーテル類(エチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランなど)、エステル類(酢酸エチルなど)、ハロゲン化炭化水素類(クロロホルム、ジクロロメタンなど)、アミド類(N,N-ジメチルホルムアミドなど)、芳香族アミン類(ピリジンなど)、水などが例示でき、適宜混合しても良い。また、塩基としては、例えば、アルカリ金属水酸化物(水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど)、炭酸水素塩(炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなど)、炭酸塩(炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなど)、酢酸塩(酢酸ナトリウムなど)、3級アミン類(トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-メチルモルホリンなど)、芳香族アミン類(ピリジン、ピコリン、N,N-ジメチルアニリンなど)などが挙げられる。塩基の使用量は、通常、基質1モルに対して、約1~100モル当量、好ましくは約1~5モル当量程度である。反応温度は、通常、約-80~150℃、好ましくは約0~50℃程度であり、反応時間は、通常、約0.5~48時間、好ましくは0.5~16時間程度である。

「反応性誘導体を経る方法」において示される反応性誘導体としては、例えば、酸ハライド、酸無水物、混合酸無水物、活性エステルなどが挙げられる。反応性誘導体への変換は、それ自体公知の方法に準じて行うことができるが、例えば、酸ハライドへの変換としては、酸ハロゲン化物(例、塩化チオニル、塩化オキサリルなど)を用いる方法、リンおよびリン酸のハロゲン化物(例、3塩化リン、5塩化リンなど)を用いる方法などが挙げられる。上記反応性誘導体を用いる反応では、反応性誘導体あるいは基質の種類によっても異なるが、通常、反応に悪影響を及ぼさない溶媒中で行われ、反応促進のため便宜の塩基を添加しても良い。反応で使用される溶媒および塩基の種類、使用量、反応温度ならびに反応時間は、上記「縮合剤を用いる方法」において記載した内容と同様である。

#### 【0031】

(工程4)

本工程は化合物(IIIa)と、式  
 $Z-L^2$  (XII)

[式中の $L^2$ は脱離基を、Zは上記と同意義を示す。]で表される化合物またはその塩を反応させることによって化合物(Ia)を製造する工程である。

$L^2$ で示される脱離基としては、例えば、ハロゲン原子(塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子など)、置換スルホニルオキシ基(メタンスルホニルオキシ基、エタンスルホニルオキシ基、ベンゼンスルホニルオキシ基、トルエンスルホニルオキシ基、ベンジルスルホニルオキシ基など)、アシルオキシ基(アセトキシ基、ベンゾイルオキシ基など)、ヘテロ環あるいはアリール基で置換されたオキシ基(コハク酸イミド、ベンゾトリアゾール、キノリン、4-ニトロフェニルなど)、ヘテロ環(イミダゾールなど)などが用いられ、特にハロゲン原子が好ましい。化合物(XII)の使用量は、例えば、化合物(IIIa)1モルに対して約1~5モル当量、好ましくは約1~3モル当量程度である。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 欄の続き

国際特許分類 (IPC) の続き

Int. Cl<sup>7</sup> A61P1/18, 3/00, 5/00, 7/00, 9/00, 11/00, 11/02, 13/02



## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

〔2〕請求の範囲 2-4 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1 と国際調査報告で引用された上記文献 2-6 とにより進歩性を有しない。

上記〔1〕参照。

請求の範囲 2-4 に係る化合物は、文献 1 記載の化合物とは、請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) における含窒素複素環 (A 環に相当) 芳香環 (B 環及び C 環に相当) に結合する置換基において相違している。

しかしながら、文献 1 記載の化合物に構造の非常に類似した、医薬として有用な化合物が種々記載された文献 2-6 には、含窒素複素環の窒素に結合する置換基としてアシル基、芳香環上の置換基としてハロゲン化アルキル基等が好ましいものとして記載されている。

そうしてみると、文献 1 に記載の医薬として有用な化合物において、文献 2-6 記載の置換基を採用してみることは、当業者であれば、容易に想到し得るものと認められる。

そして、請求の範囲 2-4 に係る化合物が、上記文献に記載された公知化合物に比較して、予想外の効果を奏するものとも認められない。

〔3〕請求の範囲 8、9、11 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1 と国際調査報告で引用された上記文献 2-6 とにより進歩性を有しない。

上記〔1〕及び〔2〕参照。

文献 2-6 に記載されるように、含窒素複素環と二つの芳香環を必須とする化合物からなるタキキニン受容体拮抗剤として有用な化合物は種々知られており、請求の範囲 1-4 に係る化合物は、文献 2 記載の化合物とは、請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) における含窒素複素環 (A 環に相当) と、芳香環 (B 環に相当) に結合するメチレンとの結合が、アミド結合である点のみ相違している。

しかしながら、文献 3-6 には、含窒素複素環と、芳香環に結合するメチレンとの結合が、アミド結合であるタキキニン受容体拮抗剤として有用な化合物が種々記載されている。

そうしてみると、文献 2 に記載のタキキニン受容体拮抗剤として有用な化合物において、含窒素複素環と、芳香環に結合するメチレンとの結合部位にアミド結合を採用してみることは、当業者であれば、容易に想到し得るものと認められる。

そして、請求の範囲 8、9、11 に係るタキキニン受容体拮抗剤が、上記文献に記載されたタキキニン受容体拮抗剤に比較して、予想外の効果を奏するものとも認められない。